

DIALOG(R)File 351:Derwent WPI  
(c) 2001 Derwent Info Ltd. All rts. reserv.

010239249 \*\*Image available\*\*  
WPI Acc No: 1995-140504/\*199519\*  
XRAM Acc No: C95-064851

**Cosmetic compsn. contg. 1-hydroxy-2-pyridone deriv. - for use against dandruff and as deodorant**

Patent Assignee: HOECHST AG (FARH ); CLARIANT GMBH (CLRN )

Inventor: HAENEL H; RENG A K; SIMSCH W

Number of Countries: 015 Number of Patents: 010

Patent Family:

| Patent No   | Kind | Date     | Applicat No | Kind | Date     | Week     |
|-------------|------|----------|-------------|------|----------|----------|
| EP 646369   | A1   | 19950405 | EP 94115183 | A    | 19940927 | 199519 B |
| DE 4333893  | A1   | 19950406 | DE 4333893  | A    | 19931005 | 199519   |
| CA 2133631  | A    | 19950406 | CA 2133631  | A    | 19941004 | 199527   |
| BR 9403975  | A    | 19950613 | BR 943975   | A    | 19941004 | 199530   |
| JP 7187968  | A    | 19950725 | JP 94240361 | A    | 19941004 | 199538   |
| US 5494658  | A    | 19960227 | US 94317030 | A    | 19941003 | 199614   |
| CN 1106651  | A    | 19950816 | CN 94117874 | A    | 19941004 | 199731   |
| EP 646369   | B1   | 19981209 | EP 94115183 | A    | 19940927 | 199902   |
| DE 59407435 | G    | 19990121 | DE 507435   | A    | 19940927 | 199909   |
|             |      |          | EP 94115183 | A    | 19940927 |          |
| ES 2127862  | T3   | 19990501 | EP 94115183 | A    | 19940927 | 199924   |

Priority Applications (No Type Date): DE 4333893 A 19931005

Cited Patents: 02Jnl.Ref; DE 2234009; EP 241918; EP 386900; JP 5822010; US 4185106

Patent Details:

| Patent No   | Kind | Lan | Pg | Main IPC     | Filing Notes              |
|---|------|-----|----|--------------|---------------------------|
| EP 646369   | A1   | G   | 10 | A61K-007/06  |                           |
| Designated States (Regional): AT BE CH DE ES FR GB IT LI NL |      |     |    |              |                           |
| DE 4333893  | A1   |     | 9  | A61K-007/075 |                           |
| JP 7187968  | A    |     | 9  | A61K-007/075 |                           |
| US 5494658  | A    |     | 6  | A61K-007/06  |                           |
| EP 646369   | B1   | G   |    | A61K-007/06  |                           |
| Designated States (Regional): AT BE CH DE ES FR GB IT LI NL |      |     |    |              |                           |
| DE 59407435   | G    |     |    | A61K-007/06  | Based on patent EP 646369 |
| ES 2127862  | T3   |     |    | A61K-007/06  | Based on patent EP 646369 |
| CA 2133631  | A    |     |    | A61K-007/32  |                           |
| BR 9403975  | A    |     |    | A61K-007/075 |                           |
| CN 1106651  | A    |     |    | A61K-007/075 |                           |

Abstract (Basic): EP 646369 A

Cosmetic compsns. contain 1-hydroxy-2-pyridone cpds. of formula (I) and/or their salts.

R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub> = H or 1-4C alkyl (pref. R<sub>1</sub> = R<sub>3</sub> = H; R<sub>2</sub> = Me); X = S or O; Y = H or 1-2 halogens, pref. Cl and/or Br; Z = a bond or -O-. -S-. -CH<sub>2</sub>-. -CH<sub>2</sub>-O-, -O-CH<sub>2</sub>- CH<sub>2</sub>-S-, -S-CH<sub>2</sub>- or -CH=CH-CH<sub>2</sub>-O; Ar = aromatic system with 1-2 rings, opt.substd. with 1-3 F, Cl, Br, methoxy, 1-4C alkyl, CF<sub>3</sub> or trifluoromethoxy.

USE - The compsns. are used against dandruff, or as deodorants (claimed), esp. as shampoos, hair care compsns., hair rinses, curatives, lotions or sprays, gels or creams for dressing hair, hair oils or pomades, or brilliantine.

ADVANTAGE - Small amts. of (I) are used. (I) have wide spectrum of antimicrobial activity and low toxicity.

Dwg.0/0

Abstract (Equivalent): US 5494658 A

A cosmetic preparation comprising, a compound present in an amount of from 0.05 to 10% of the formula (I), in which R', R<sub>2</sub>, and R<sub>3</sub> are identical or different and are hydrogen or alkyl

# Dialog Search

with 1 to 4 carbon atoms,

X is S or O,

Y is hydrogen or up to two halogen atoms,

Z is a single bond or the divalent radicals O, S, -CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-O-,  
-O-CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-S-, -S-CH<sub>2</sub>- or -CH=CH-CH<sub>2</sub>-O-,

Ar is an aromatic ring system which is phenyl, naphthyl,  
tetrahydronaphthyl, indenyl, biphenyl, diphenylether, or  
diphenylthioether and which can be substituted by up to three radicals  
selected from the group consisting of fluorine, chlorine, bromine,  
methoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, trifluoromethyl, and trifluoromethoxy, and their  
salts, or compounds of formula I or their salts, said compound of the  
formula I being present in sufficient quantity to have an antidandruff  
effect, and

a detergent raw material selected from the group consisting of  
anionic, cationic, nonionic and amphoteric detergent substances for  
application to the hair and scalp.

Dwg.0/0

Title Terms: COSMETIC; COMPOSITION; CONTAIN; HYDROXY; PYRIDONE; DERIVATIVE;  
DANDRUFF; DEODORISE

Derwent Class: B03; D21; D22; E13

International Patent Class (Main): A61K-007/06; A61K-007/075; A61K-007/32

International Patent Class (Additional): A61K-007/00; A61K-007/08;

A61K-007/48; A61K-007/50; C07D-213/89

File Segment: CPI

Manual Codes (CPI/A-N): B07-D04D; B14-A01; B14-R01; B14-R02; D08-B04;

D08-B05; D08-B09B; D09-A01; E07-D04D

Chemical Fragment Codes (M2):

\*01\* F011 F012 F013 F014 F015 F016 F432 G002 G010 G011 G012 G013 G014  
G015 G016 G017 G019 G020 G021 G022 G029 G040 G100 G111 G221 H5 H541  
H542 H543 H594 H599 H600 H601 H602 H603 H608 H609 H641 H642 H643  
H685 H689 H721 J5 J521 K0 K8 K850 L9 L941 M111 M112 M121 M122 M141  
M142 M150 M210 M211 M212 M213 M214 M215 M216 M231 M232 M233 M240  
M272 M280 M281 M282 M283 M311 M312 M321 M322 M323 M332 M342 M344  
M353 M362 M373 M383 M391 M392 M393 M413 M510 M521 M532 M540 M630  
M640 M650 M781 M903 M904 P200 P930 Q252 9519-05001-U

Chemical Fragment Codes (M3):

\*01\* F011 F012 F013 F014 F015 F016 F432 G002 G010 G011 G012 G013 G014  
G015 G016 G017 G019 G020 G021 G022 G029 G040 G100 G111 G221 H5 H541  
H542 H543 H594 H599 H600 H601 H602 H603 H608 H609 H641 H642 H643  
H685 H689 H721 J5 J521 K0 K8 K850 L9 L941 M111 M112 M121 M122 M141  
M142 M150 M210 M211 M212 M213 M214 M215 M216 M231 M232 M233 M240  
M272 M280 M281 M282 M283 M311 M312 M321 M322 M323 M332 M342 M344  
M353 M362 M373 M383 M391 M392 M393 M413 M510 M521 M532 M540 M630  
M640 M650 M781 M903 M904 P200 P930 Q252 9519-05001-U

Generic Compound Numbers: 9519-05001-U



Europäisches Patentamt  
European Patent Office  
Office européen des brevets



Veröffentlichungsnummer: **0 646 369 A1**

(2)

## EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG

(21) Anmeldenummer: 94115183.9

(51) Int. Cl.<sup>6</sup>: A61K 7/06, A61K 7/32

(22) Anmeldetag: 27.09.94

(30) Priorität: 05.10.93 DE 4333893

(43) Veröffentlichungstag der Anmeldung:  
05.04.95 Patentblatt 95/14

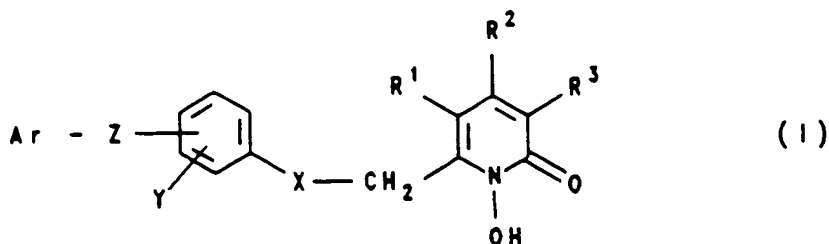
(34) Benannte Vertragsstaaten:  
AT BE CH DE ES FR GB IT LI NL

(71) Anmelder: HOECHST AKTIENGESELLSCHAFT  
Brüningstrasse 50  
D-65929 Frankfurt am Main (DE)

(72) Erfinder: Hänel, Heinz, Dr.  
Taunusstrasse 148  
D-61440 Oberursel (DE)  
Erfinder: Simsch, Waltraud  
Berliner Ring 13  
D-65779 Kelkheim (DE)  
Erfinder: Reng, Alwin K.  
Im Schulzehnten 22  
D-65779 Kelkheim (DE)

(54) Kosmetische Zubereitungen enthaltend 1-Hydroxy-2-Pyridone als Antischuppen- und desodorisierenden Mittel.

(57) Die Erfindung betrifft kosmetische Zubereitungen, welche gekennzeichnet sind durch einen Gehalt an Verbindungen der allgemeinen Formel I



worin

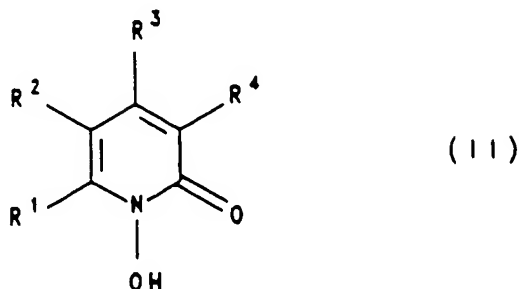
- R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> gleich oder verschieden sind und Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen bedeuten, wobei R<sup>1</sup> und R<sup>3</sup> vorzugsweise Wasserstoff sind und R<sup>2</sup> vorzugsweise Methyl ist,
- X S oder O,
- Y Wasserstoff oder bis zu zwei Halogenatome, vorzugsweise Chlor und/oder Brom,
- Z eine Einfachbindung oder die zweiwertigen Reste O, S, -CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-O-, -O-CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-S-, -S-CH<sub>2</sub>- oder -CH = CH-CH<sub>2</sub>-O-,
- Ar ein aromatisches Ringsystem mit bis zu zwei Ringen, das durch bis zu drei Resten aus der Gruppe Fluor, Chlor, Brom, Methoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, Trifluormethyl und Trifluormethoxy substituiert sein kann,

und oder deren Salzen.

Gegenstand der Erfindung ist ferner die Verwendung dieser kosmetischen Zubereitungen als Antischuppenmittel und als desodorisierendes kosmetisches Mittel.

EP 0 646 369 A1

Aus der DE-C-22 34 009 sind kosmetische Zubereitungen bekannt, die durch einen Gehalt an Verbindungen der allgemeinen Formel II



gekennzeichnet sind. In der obigen Formel II ist

R<sup>1</sup> u.a. Aryloxyalkyl mit Alkyl von 1 bis 4 Kohlenstoffatomen.

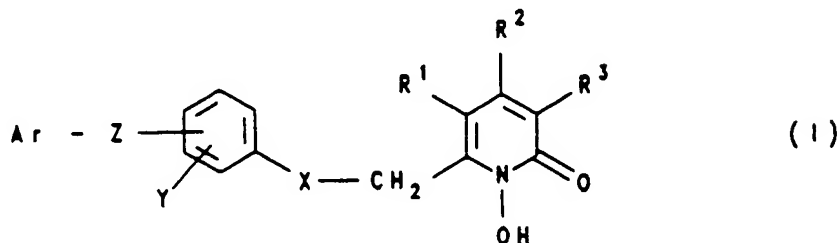
R<sup>2</sup> u.a. Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen.

20 R<sup>3</sup> u.a. Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und

R<sup>4</sup> u.a. Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen.

Der Rest R<sup>1</sup> wird spezifisch nur als Phenyloxymethyl angegeben.

Aus der EP-A-0 241 918 sind Verbindungen der Formel I bekannt



worin

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> gleich oder verschieden sind und Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen bedeuten, wobei R<sup>1</sup> und R<sup>3</sup> vorzugsweise Wasserstoff sind und R<sup>2</sup> vorzugsweise Methyl ist.

X S oder vorzugsweise O.

Y Wasserstoff oder bis zu zwei Halogenatome, vorzugsweise Chlor und/oder Brom.

Z eine Einfachbindung oder die zweiwertigen Reste O, S, -CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-O-, -O-CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-S-, -S-CH<sub>2</sub>- oder -CH = CH-CH<sub>2</sub>-O-.

45 Ar ein aromatisches Ringsystem ist mit bis zu zwei Ringen, das durch bis zu drei Reste aus der Gruppe Fluor, Chlor, Brom, Methoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, Trifluormethyl und Trifluor-methoxy substituiert sein kann.

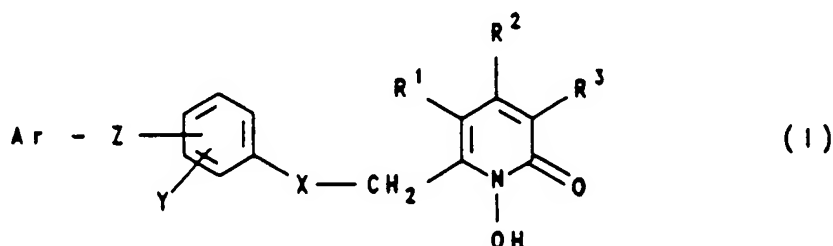
Als wichtiger Vertreter der durch die Formel I charakterisierten Verbindungsklasse wird u.a. 6-[4-(4-Chlor-phenoxy)-phenoxy-methyl]-1-hydroxy-4-methyl-2-pyridon genannt. Diese Verbindung wird zur Vereinfachung nachfolgend als Rilopirox bezeichnet.

Die Verbindungen der allgemeinen Formel I besitzen topische antimykotische Eigenschaften mit einem breiten Wirkungsspektrum gegenüber pathogenen Pilzen, die sowohl die Haut als auch die Schleimhaut befallen, wie Hefen sowie Schimmelpilze. Diese Verbindungen können deshalb zur Bekämpfung von Infektionen durch diese Erreger in der Human- und Veterinärmedizin eingesetzt werden. Die Anwendung kann als freie Hydroxypyridone oder in Form ihrer physiologisch verträglichen Salze mit anorganischen oder organischen Basen in den für die Bekämpfung von Pilzen üblichen Zubereitungsformen, wie Lösungen, Suspensionen, Cremes, Salben, Puder oder Suppositorien (Ovula) erfolgen.

Aus EP-A-0 241 918 ist lediglich die Verwendung der Verbindungen der Formel I als Arzneimittel bekannt.

Die Aufgabe der vorliegenden Erfindung besteht nun darin, kosmetische Zubereitungen, insbesondere Antischuppenmittel und desodorierende kosmetische Mittel zur Verfügung zu stellen.

Die vorliegende Erfindung betrifft kosmetische Zubereitungen, gekennzeichnet durch einen Gehalt an Verbindungen der allgemeinen Formel I



worin

- 20  $R^1$ ,  $R^2$  und  $R^3$  gleich oder verschieden sind und Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen bedeuten, wobei  $R^1$  und  $R^3$  vorzugsweise Wasserstoff sind und  $R^2$  vorzugsweise Methyl ist.
- $X$  S oder vorzugsweise O.
- $Y$  Wasserstoff oder bis zu zwei Halogenatome, vorzugsweise Chlor und/oder Brom.
- 25  $Z$  eine Einfachbindung oder die zweiwertigen Reste O, S,  $-\text{CH}_2-$ ,  $-\text{CH}_2-\text{O}-$ ,  $-\text{O}-\text{CH}_2-$ ,  $-\text{CH}_2-\text{S}-$ ,  $-\text{S}-\text{CH}_2-$  oder  $-\text{CH} = \text{CH}-\text{CH}_2-\text{O}-$ .
- $Ar$  ein aromatisches Ringsystem mit bis zu zwei Ringen, das durch bis zu drei Reste aus der Gruppe Fluor, Chlor, Brom, Methoxy,  $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -Alkyl, Trifluormethyl und Trifluormethoxy substituiert sein kann.

30 und/oder deren Salzen.

Der Begriff aromatische Ringsysteme umfaßt Phenyl und kondensierte Systeme, wie Naphthyl, Tetrahydronaphthyl und Indenyl, sowie isolierte Systeme, die sich vom Biphenyl, Diphenylalkanen, Diphenylethern und Diphenylthioethern ableiten.

Diese kosmetischen Zubereitungen werden bevorzugt als Antischuppenmittel oder als desodorierendes 35 kosmetisches Mittel verwendet.

Als bevorzugtes Beispiel für in den kosmetischen Zubereitungen erfindungsgemäß als Wirkstoff einsetzbare Substanz sei die folgende Verbindung genannt:

6-[4-(4-Chlor-phenoxy)-phenoxy-methyl]-1-hydroxy-2-pyridon (genannt: Rilopirox)

Die obengenannten Verbindungen können sowohl in freier Form als auch als Salze eingesetzt werden.

40 Kommen organische Basen zur Anwendung, so werden vorzugsweise schwer flüchtige Basen eingesetzt, wie beispielsweise niedrigmolekulare Alkanolamine, wie z.B. Ethanolamin, Diethanolamin, N-Ethylethanolamin, N-Methyldiethanolamin, Triethanolamin, Diethylamino-ethanol, 2-Amino-2-methyl-n-propanol, Dimethylaminopropanol, 2-Amino-2-methyl-propandiol, Triisopropanolamin. Als weitere schwerer flüchtige Basen seien beispielsweise erwähnt Ethylendiamin, Hexamethyldiamin, Morpholin, Piperidin, Piperazin, 45 Cyclohexylamin, Tributylamin, Dodecylamin, N,N-Dimethyl-dodecylamin, Stearylamin, Oleylamin, Benzylamin, Dibenzylamin, N-Ethyl-benzylamin, Dimethylstearylamin, N-Methylmorpholin, N-Methylpiperazin, 4-Methylcyclohexylamin, N-Hydroxyethyl-morpholin. Auch die Salze quartärer Ammoniumhydroxide, wie z.B. Trimethylbenzylammoniumhydroxid, Tetramethylammoniumhydroxid oder Tetraethylammoniumhydroxid können verwendet werden, ferner Guanidin und seine Abkömmlinge, insbesondere seine Alkylierungsprodukte. Es ist jedoch auch möglich, als Salzbildner beispielsweise niedrigmolekulare Alkylamine, wie z.B. 50 Methylamin, Ethylamin oder Triethylamin einzusetzen. Auch Salze mit anorganischen Kationen, wie beispielsweise Alkalisalze, insbesondere Natrium-, Kalium- oder Ammonium-Salze, Erdalkalisalze, wie insbesondere das Magnesium- oder Calciumsalz, sowie Salze mit 2 bis 4-wertigen Kationen, wie beispielsweise das Zink-, Aluminium- oder Zirkon-Salz kommen für die erfindungsgemäß einzusetzenden Verbindungen in 55 Betracht.

Die in den kosmetischen Zubereitungen einzusetzenden Wirkstoffe der oben wiedergegebenen Formel können beispielsweise nach Verfahren hergestellt werden, wie sie in dem US-Patent 4 797 409 beschrieben werden. Die Herstellung der obengenannten Salze erfolgt in bekannter Weise durch Zusammengeben von

vorzugsweise äquimolaren Mengen der salzbildenden Komponenten.

Für den erfindungsgemäßen Einsatz der genannten Verbindungen kommen die unterschiedlichsten kosmetischen Zubereitungen in Betracht, insbesondere Shampoos. Als Beispiele für weitere erfindungsgemäß in Betracht kommende Zubereitungen seien folgende Haarpflege- und Frisiermittel erwähnt: Haarspülmittel, Haarkuren, Haarregeneriermittel, Haarwässer, Wasserwellotionen, Haarspray's, Frisiercremes, Frisiergels, Haaröle, Haarpomaden oder Haarbrillantinen. Es handelt sich demnach immer um Zubereitungen, die je nach ihrem eigentlichen Anwendungszweck für kürzere oder längere Zeit auf das Haar und die Kopfhaut aufgebracht werden. Durch die Zugabe der erfindungsgemäßen Verbindungen wird dann eine gleichzeitige Schuppenbehandlung bewirkt. Es ist jedoch auch möglich, Zubereitungen herzustellen, die in erster Linie oder ausschließlich dem Ziel einer Schuppenbeseitigung dienen.

Werden die erfindungsgemäßen Antischuppenzubereitungen als Shampoos dargeboten, so können diese klarflüssig, opakflüssig (mit Perlglanzeffekt), cremeförmig, gelartig, aber auch pulverförmig oder in Tablettenform, sowie als Aerosole konditioniert sein. Die diesen Shampoos zugrunde liegenden Waschrohstoffe können anionischer, kationischer, nichtionischer und amphoterer Natur sein und auch in Kombinationen dieser Stoffe vorliegen.

Als Beispiele für derartige anionische waschaktive Substanzen seien genannt: C<sub>10</sub>-C<sub>20</sub>-Alkyl- und Alkylencarboxylate, Alkylethercarboxylate, Fettalkoholsulfate, Fettalkoholethersulfate, Alkylolamidsulfate und -sulfonate, Fettsäurealkylolamidpolyglykolethersulfate, Alkansulfonate und Hydroxyalkansulfonate, Olefinsulfonate, Acylester von Isethionaten,  $\alpha$ -Sulfofettsäureester, Alkylbenzolsulfonate, Alkylphenolglykolethersulfonate, Sulfosuccinate, Sulfobernsteinsäurehalbester und -diester, Fettalkoholetherphosphate, Eiweiß-Fettsäure-Kondensationsprodukte, Alkylmonoglyceridsulfate und -sulfonate, Alkylglyceridethersulfonate, Fettsäuremethyltauride, Fettsäuresarkosinate, Sulfocinoleate. Diese Verbindungen und deren Mischungen werden in Form ihrer wasserlöslichen oder in Wasser dispergierbaren Salze benutzt, beispielsweise der Natrium-, Kalium-, Magnesium-, Ammonium-, Mono-, Di- und Triethanolammonium- sowie analogen Alkylammonium-Salze.

Geeignete kationische Tenside sind beispielsweise quartäre Ammonium-Salze wie Di-(C<sub>12</sub>-C<sub>24</sub>-Alkyl)-dimethylammonium-chlorid oder -bromid, vorzugsweise Di-(C<sub>12</sub>-C<sub>18</sub>-Alkyl)-dimethylammonium-chlorid oder -bromid; C<sub>10</sub>-C<sub>24</sub>-Alkyl-dimethyl-ethylammonium-chlorid oder -bromid; C<sub>10</sub>-C<sub>24</sub>-Alkyl-trimethylammonium-chlorid oder -bromid, vorzugsweise Cetyl-trimethylammonium-chlorid oder -bromid und C<sub>20</sub>-C<sub>22</sub>-Alkyl-trimethylammonium-chlorid oder -bromid; C<sub>10</sub>-C<sub>24</sub>-Alkyl-dimethylbenzylammonium-chlorid oder -bromid, vorzugsweise C<sub>12</sub>-C<sub>18</sub>-Alkyl-dimethylbenzylammonium-chlorid; N-(C<sub>10</sub>-C<sub>18</sub>-Alkyl)-pyridinium-chlorid oder -bromid, vorzugsweise N-(C<sub>12</sub>-C<sub>16</sub>-Alkyl)-pyridinium-chlorid oder -bromid; N-(C<sub>15</sub>-C<sub>18</sub>-Alkyl)-isocholinium-chlorid, -bromid oder -monoalkylsulfat; N-(C<sub>12</sub>-C<sub>18</sub>-Alkyl)-N-methylmorpholinium-chlorid, -bromid oder -monoalkylsulfat; N-(C<sub>12</sub>-C<sub>18</sub>-Alkyl)-N-ethylmorpholinium-chlorid, -bromid oder -monoalkylsulfat; C<sub>16</sub>-C<sub>18</sub>-Alkyl-pentaoxethylammonium-chlorid; Diisobutylphenoxyethoxyethyl-dimethylbenzylammonium-chlorid; Salze des N,N-Diethylaminoethylstearylams und -oleylams mit Salzsäure, Essigsäure, Milchsäure, Zitronensäure, Phosphorsäure; N-Acylamidoethyl-N,N-diethyl-N-methylammoniumchlorid, -bromid oder -monoalkylsulfat und N-Acylaminoethyl-N,N-diethyl-N-benzylammonium-chlorid, -bromid oder -monoalkylsulfat, wobei Acyl vorzugsweise für Stearyl oder Oleyl steht.

Als nichtionische Tenside, die als waschaktive Substanzen eingesetzt werden können, kommen beispielsweise in Betracht: Fettalkoholethoxylate (Alkylpolyethylenglykole); Alkylphenolpolyethylenglykole; Alkylmercaptanpolyethylenglykole; Fettaminethoxylate (Alkylaminopolyethylenglykole); Fettsäureethoxylate (Acylpolyethylenglykole); Polypropylenglykolethoxylate (Pluronic); Fettsäurealkylolamide (Fettsäureamidpolyethylenglykole); Saccharoseester; Sorbitester und der Polyglykolether.

Beispiele für den Shampoos zusetzbare Amphotenside sind: N-(C<sub>12</sub>-C<sub>18</sub>-Alkyl)- $\beta$ -aminopropionate und N-(C<sub>12</sub>-C<sub>18</sub>-Alkyl)- $\beta$ -iminodipropionate als Alkali- und Mono-, Di- und Trialkylammonium-Salze; N-Acylamidoalkyl-N,N-dimethylacetobetain, vorzugsweise N-(C<sub>8</sub>-C<sub>18</sub>-Acyl)amidopropyl-N,N-dimethylacetobetain; C<sub>12</sub>-C<sub>18</sub>-Alkyl-dimethyl-sulfoethylbetain; Amphotenside auf Basis Imidazolin (Handelsname: Miranol<sup>®</sup>, Steinapon<sup>®</sup>), vorzugsweise das Natrium-Salz des 1-( $\beta$ -Carboxy-methoxyethyl)-1-(carboxymethyl)-2-laurylimidazoliniums; Aminoxyd, z.B. C<sub>12</sub>-C<sub>18</sub>-Alkyldimethylaminoxid, Fettsäureamidoalkyl-dimethylaminoxid.

Die erfindungsgemäßen Zubereitungen können außerdem weitere in der Kosmetik gebräuchliche Zusätze enthalten, z.B. Riechstoffe, Farbstoffe, auch solche, die gleichzeitig die Haare färben oder tönen, Lösungsmittel, Trübungsmittel und Perlglanzmittel, beispielsweise Ester von Fettsäuren mit Polyolen, Magnesium- und Zink-Salze von Fettsäuren, Dispersionen auf Basis Mischpolymerer, Verdickungsmittel wie Natrium-, Kalium-, Ammoniumchlorid, Natriumsulfat, Fettsäurealkylolamide, Cellulosederivate, natürliche Gummen, ferner Pflanzenextrakte, Eiweißderivate wie Gelatine, Collagenhydrolysate, Polypeptide auf natürlicher und synthetischer Basis, Eigelb, Lecithin, Lanolin und Lanolinderivate, Fette, Öle, Fettalkohole,

Silicone, desodorierende Mittel, antimikrobiell wirksame Substanzen, antiseborrhoisch wirksame Substanzen, Stoffe mit keratolytischer und keratoplastischer Wirkung, wie beispielsweise Schwefel, Salicylsäure, Enzyme.

Zur Herstellung der kosmetischen Zubereitungen wird die Wirksubstanz bei einer Temperatur im Bereich von 20 - 60 °C, vorzugsweise bei Raumtemperatur, in dem zum Einsatz kommenden Tensid unter Rühren gelöst. Anschließend werden die einzelnen gebräuchlichen Zusätze zugegeben.

Im Fall von alkoholhaltigen kosmetischen Zubereitungen wird die Wirksubstanz in dem Alkohol bei einer Temperatur im Bereich von 20 - 40 °C, vorzugsweise bei Raumtemperatur, gelöst. Anschließend werden die einzelnen gebräuchlichen Zusätze zugegeben.

Im Fall von Haarspülmitteln bzw. O.W-Emulsionen wird der Wirkstoff in der Fettphase, d.h. zusammen mit dem Öl und dem Emulgator, bei einer Temperatur im Bereich von 70 bis 90 °C, vorzugsweise 75 °C, gelöst. Anschließend wird heißes Wasser zugegeben und die Emulsion so lange gerührt, bis sie erkaltet ist.

Die Herstellung der Shampoos erfolgt in an sich bekannter Weise durch Zusammengeben der einzelnen Komponenten und eine - soweit erforderlich - der jeweiligen Zubereitungsart angepaßte Weiterverarbeitung. Einige dieser vielfältigen möglichen Zubereitungsformen werden in den Ausführungsbeispielen beispielhaft beschrieben.

Als weitere haarkosmetische Zubereitungen, in denen die 1-Hydroxi-2-pyridone erfindungsgemäß zur Anwendung kommen können, seien beispielsweise genannt: Haarspülmittel (sogenannte Hair rinses), Haarkuren und Haarregeneriermittel, die nach einer gewissen Zeit vom Haar abgespült werden oder je nach Formulierung auch auf dem Haar verbleiben können. Diese Präparate enthalten unter anderem Substanzen aus der Gruppe der obenerwähnten kationische Tensiden, die am Haar eine avivierende und antistatische Eigenschaft entfalten.

Die erfindungsgemäßen Antischuppenzubereitungen können auch in Form von wäßrigen und wäßrig-alkoholischen Haarwässern, Wasseremulsionen (Haarfestiger), auch solcher in Gelform, und in Aerosolform als Haarspray, sowie in Form von Haarpflege- und Frisiercremes und -gels dargeboten werden. Als Alkohole werden vorzugsweise Ethanol und Isopropanol eingesetzt.

Beispiele für Harze mit haarfestigender und frisurenfestigender Wirkung, die in einer Konzentration von 0,5 bis 6 Gew.-%, vorzugsweise 1 bis 3 Gew.-%, in den entsprechenden Zubereitungen (Haarfestiger, Haarspray) enthalten sein können, sind: Schellack und -derivate, Umsetzungsprodukte von Kolophonium mit Acrylsäure, Poly-N-vinylpyrrolidon und alkylsubstituierte Poly-N-vinylpyrrolidon, Poly-N-vinyl-N-alkyl-acetamid, Polyvinylacetat und partiell verseiftes Polyvinylacetat, Polyvinylalkohol, Alkylester der Acrylsäure, Mischpolymerisate aus Vinylacetat und N-Vinyl-N-alkylacetamid, Mischpolymerisate aus Vinylacetat und N-Vinylpyrrolidon, Umsetzungsprodukte aus Mischpolymerisaten aus Vinylacetat und Acrylsäure bzw. Crotonsäure mit organischen Basen, Mischpolymerisate aus Vinylacetat und Maleinsäurehalbester, Mischpolymerisate aus Vinylacetat, Vinylpivalat und Crotonsäure, Mischpolymerisate aus Fettsäurevinylestern und (Meth)acrylsäure, Mischpolymerisate aus (Meth)acrylsäureestern und N-Vinylpyrrolidon, Mischpolymerisate aus Acrylsäureestern und (Meth)acrylsäure, Alkylester aus Mischpolymerisaten aus Methylvinylether und Maleinsäureanhydrid, Alkylester aus Mischpolymerisaten aus Olefinen und Maleinsäureanhydrid, Polyvinylacetale und Polyvinylbutyrale, Dimethylhydantoin-Formaldehyd-Kondensate, Cyclohexanon-Formaldehyd-Harze, Phthalatharze, Eiweißhydrolysate und Eiweißderivate, Stärke- und Cellulose-derivate, die auch kationische Gruppen enthalten können, sowie weitere Filmbildner mit quartären Gruppen wie Umsetzungsprodukte von Mischpolymeren aus Alkyl(meth)acrylaten und Dimethylaminoethyl(meth)acrylat mit Alkylierungsmitteln, ferner quartäre Copolymere aus N-Vinylpyrrolidon und Dialkylaminoalkyl(meth)acrylaten.

Es ist weiterhin möglich, die erfindungsgemäß einsetzbaren Verbindungen in wasserfreien öligen Zubereitungen wie Haaröl, Haarpomade, Haarbrillantine einzuarbeiten.

Auch die Herstellung aller dieser Zubereitungen erfolgt - wie bereits beim Shampoo erwähnt - in an sich bekannter Weise unter Zugabe des erfindungsgemäß eingesetzten Wirkstoffs. Die erfindungsgemäßen Antischuppenzubereitungen können von den obengenannten 1-Hydroxi-2-pyridonen eine Verbindung oder auch mehrere in Kombination enthalten.

In die erfindungsgemäßen Zubereitungen wird der Antischuppenwirkstoff in Mengen eingearbeitet, die üblicherweise zwischen etwa 0,05 und etwa 10 % liegen. Innerhalb dieses Bereiches richten sich die Konzentrationen der speziellen Zubereitungen nach ihrem Anwendungszweck. Bestimmte Zubereitungsformen, wie z.B. Konzentrate, die vor ihrer Anwendung zu verdünnen sind, können auch erheblich höhere Konzentrationen aufweisen.

Handelt es sich um Zubereitungen, die auf dem Haar verbleiben, wie beispielsweise Haarwasser, Haarfestiger, Cremes usw., so wird man niedrigere Konzentrationen einsetzen, beispielsweise von ca. 0,01 bis ca. 1 %, vorzugsweise 0,1 bis 0,5 %. In höheren Konzentrationen werden sie zweckmäßigerweise dann zur Anwendung kommen, wenn es sich um kosmetische Zubereitungen handelt, die, gegebenenfalls nach

Verdünnung, nur kurze Zeit auf Haar und Kopfhaut einwirken, wie beispielsweise Shampoos oder Haarspülmittel. In diesen Fällen können z.B. Konzentrationen von etwa 0,2 bis etwa 10 %, vorzugsweise etwa 0,5 bis etwa 2 %, zweckmäßig sein.

Es ist bekannt, daß 1-Hydroxi-2-pyridinthione und deren Salze, insbesondere das Zinksalz, gegen Schuppen wirksam sind. Es war nicht zu erwarten, daß auch die schwefelfreien Verbindungen erfindungsgemäß eine ausgezeichnete Antischuppenwirkung zeigen.

Die erfindungsgemäße Verwendung der genannten 1-Hydroxi-2-pyridonen zeichnet sich insbesondere gegenüber dem erwähnten Stand der Technik durch zahlreiche Vorteile aus.

Herauszuheben sind:

- geringe Einsatzkonzentrationen
- breites antimikrobielles Wirkungsspektrum
- geringe Toxizität.

Die nachstehenden Beispiele erläutern die vorliegende Erfindung. Die Mengenangaben sind auf das Gewicht bezogen.

15

| Beispiel 1 - Cremeshampoo  |          |
|--|----------|
| Rilopirox  | 0,2 %    |
| Fettsäuremethyltaurid-Natriumsalz (® Hostapon CT-Teig, Hoechst AG) | 70 %     |
| Fettsäuremethylsulfon-Natriumsalz (® Hostapon SCID, Hoechst AG)    | 5 %      |
| Palmkernfettsäuresarkosid (® Medialan LD)                          | 5 %      |
| Wasser   | ad 100 % |

20

25

| Beispiel 2 - Antischuppenshampoo   |          |
|--|----------|
| Rilopirox  | 0,3 %    |
| Fettsäuremonoethanolamidpolyglykolether (® Genagen CA-050, Hoechst AG)   | 5 %      |
| Alkylethersulfat-Natriumsalz (® Genapol LRO fl., Hoechst AG)             | 35,0 %   |
| Acylaminopolyglykolethersulfat-Magnesiumsalz (® Genapol AMG, Hoechst AG) | 10,0 %   |
| Alkylamidopropyl-Betain (® Genagen CAB, Hoechst AG)                      | 8,0 %    |
| Konsistenzgeber (® Genapol L-3, Hoechst AG)                              | 2,0 %    |
| Natriumchlorid   | 0,7 %    |
| Wasser   | ad 100 % |

30

35

40

45

50

| Beispiel 3 - "3 in 1-Shampoo"  |          |
|--|----------|
| Rilopirox  | 0,2 %    |
| Alkylethersulfat-natriumsalz (® Genapol LRO. fl., Hoechst AG)            | 35,0 %   |
| Acylaminopolyglykolethersulfat-Magnesiumsalz (® Genapol AMG, Hoechst AG) | 5,0 %    |
| Fettsäureglutamat-natriumsalz (® Hostapon KCG, Hoechst AG)               | 5,0 %    |
| Fettsäure-Protein-Kondensat (® Hostapon SCHC, Hoechst AG)                | 5,0 %    |
| Silikonöl (® Belsil DNC 6032, Wacker Chemie)                             | 2,0 %    |
| D-Panthenol  | 1,0 %    |
| Konsistenzgeber (® Genapol L-3, Hoechst AG)                              | 2,5 %    |
| Alkylamidopropyl-Betain (® Genagen CAB, Hoechst AG)                      | 8,0 %    |
| Natriumchlorid   | 2,0 %    |
| Wasser   | ad 100 % |

55



## Beispiel 4 - Shampookonzentrat

|   |          |
|---|----------|
| Rilopirox   | 0.2 %    |
| Alkylethersulfat-Natriumsalz (® Genapol LRO Paste, Hoechst AG)        | 20.0 %   |
| Alkylamidopropyl-Betain (® Genapol CAB, Hoechst AG)                   | 33.0 %   |
| Fettsäuremonoethanolamidpolyglykoether (® Genagen CA-050, Hoechst AG) | 5.0 %    |
| Fettsäure-Protein-Kondensat (® Hostapon SCHCP, Hoechst AG)            | 5.5 %    |
| Konsistenzgeber (® Genapol L-3, Hoechst AG)                           | 3.0 %    |
| Wasser  | ad 100 % |

## Beispiel 5 - flüssige Seife

|   |          |
|---|----------|
| Rilopirox   | 0.1 %    |
| Alkylethersulfat-Natriumsalz (® Genapol LRO, Hoechst AG)      | 40.0 %   |
| sek. n-Alkylsulfonat-Natriumsalz (® Hostapur SAS, Hoechst AG) | 8.0 %    |
| Konsistenzgeber (® Genapol L-3, Hoechst AG)                   | 3.0 %    |
| Natriumchlorid  | 1.5 %    |
| Wasser  | ad 100 % |

## Beispiel 6 - Deoseife

|            |        |
|------------|--------|
| Rilopirox  | 0.2 %  |
| Grundseife | 99.8 % |

## Beispiel 7 - Roll-on Deo

|   |        |
|---|--------|
| Rilopirox   | 0.1 %  |
| Hydroxyethylcelluloseether (® Tylose H 10000, Hoechst AG) | 0.7 %  |
| Ethanol   | 40.0 % |
| 1,2-Propylenglykol  | 5.0 %  |
| Lösungsvermittler (® Cremophor RH 455, BASF AG)           | 0.5 %  |
| Wasser  | 53.0 % |

## Beispiel 8 - Deodorant

|   |          |
|---|----------|
| Rilopirox   | 0.15 %   |
| Ethanol   | 70.0 %   |
| Rückfettungsmittel (® Softigen 767, Chem. Werke Hüls) | 0.5 %    |
| Parfümöl  | 0.5 %    |
| Allantoin   | 0.1 %    |
| Wasser  | ad 100 % |

## Beispiel 9 - Intimwaschmittel

|   |          |
|---|----------|
| Rilopirox   | 0.1 %    |
| Acylaminopolyglykoethersulfat-Magnesiumsalz (® Genapol AMG, Hoechst AG) | 40.0 %   |
| Konsistenzgeber (Glucamate DOE 120, Amercol)                            | 3.0 %    |
| Wasser  | ad 100 % |

| Beispiel 10 - Haarnachspülmittel                              |  |          |
|---|--|----------|
| Rilopirox   |  | 0.2 %    |
| Cetylalkohol  |  | 2.5 %    |
| Paraffinöl  |  | 1.5 %    |
| Phosphorsäureesterverbindung (® Hostaphat KL340N, Hoechst AG) |  | 1.5 %    |
| Alkylpolyethoxyammoniumlactat (® Genamin KSL, Hoechst AG)     |  | 7.0 %    |
| Hydroxyethylcelluloseether (® Tylose, Hoechst AG)             |  | 0.6 %    |
| Wasser  |  | ad 100 % |

| Beispiel 11 - Haarwasser                                  |  |          |
|---|--|----------|
| Rilopirox   |  | 0.05 %   |
| Fettsäurepolyglykolether (® Emulsogen EL, Hoechst AG)     |  | 0.6 %    |
| Ethanol   |  | 40.0 %   |
| Alkylpolyethoxyammoniumlactat (® Genamin KSL, Hoechst AG) |  | 0.3 %    |
| D-Panthenol   |  | 0.5 %    |
| Wasser  |  | ad 100 % |

| Beispiel 12 - Haarfestiger                                |  |          |
|---|--|----------|
| Rilopirox   |  | 0.05 %   |
| Isopropanol   |  | 40.0 %   |
| Polyethylenglykol ( $\bar{M}_w = 400$ )                   |  | 0.5 %    |
| Alkylpolyethoxyammoniumlactat (® Genamin KSL, Hoechst AG) |  | 0.7 %    |
| Rückfettungsmittel  |  | 0.6 %    |
| Polyvinylpyrrolidon (® Luviskol, BASF AG)                 |  | 5.5 %    |
| Wasser  |  | ad 100 % |

| Beispiel 13 - Gesichtswasser |  |          |
|------------------------------|--|----------|
| Rilopirox                    |  | 0.05 %   |
| Ethanol                      |  | 30.0 %   |
| Rückfettungsmittel           |  | 0.2 %    |
| D-Panthenol                  |  | 0.5 %    |
| 1,2-Propylenglykol           |  | 5.0 %    |
| Allantoin                    |  | 0.1 %    |
| Extrapon Hamamelis           |  | 5.0 %    |
| Wasser                       |  | ad 100 % |

| Beispiel 14 - Öl-in-Wasser-Creme                     |  |          |
|--|--|----------|
| Rilopirox  |  | 0.1 %    |
| 1,2-Propylenglykol                                   |  | 10.0 %   |
| Öl-in-Wasser-Emulgator (® Hostacerin CG, Hoechst AG) |  | 12.0 %   |
| Ölkomponente (® Entanol G, Henkel KG & A)            |  | 8.0 %    |
| Paraffinöl   |  | 5.0 %    |
| Isopropylisostearat                                  |  | 5.0 %    |
| Konsistenzgeber (® Carbopol 940, Goodrich)           |  | 0.3 %    |
| Natronlauge (10 %ig)                                 |  | 0.4 %    |
| Wasser   |  | ad 100 % |

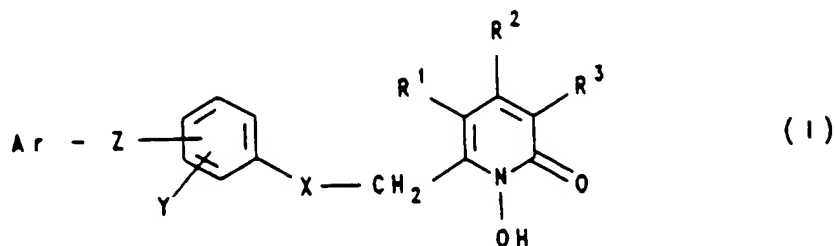
## Patentansprüche

1. Kosmetische Zubereitungen, gekennzeichnet durch einen Gehalt an Verbindungen der allgemeinen Formel I

5

10

15



worin

20

$R^1$ ,  $R^2$  und  $R^3$  gleich oder verschieden sind und Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen bedeuten, wobei  $R^1$  und  $R^3$  vorzugsweise Wasserstoff sind und  $R^2$  vorzugsweise Methyl ist.

X S oder O.

Y Wasserstoff oder bis zu zwei Halogenatome, vorzugsweise Chlor und/oder Brom.

Z eine Einfachbindung oder die zweiwertigen Reste O, S,  $-\text{CH}_2-$ ,  $-\text{CH}_2-\text{O}-$ ,  $-\text{O}-\text{CH}_2-$ ,  $-\text{CH}_2-\text{S}-$ ,  $-\text{S}-\text{CH}_2-$  oder  $-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{O}-$ .

25

Ar ein aromatisches Ringsystem mit bis zu zwei Ringen, das durch bis zu drei Resten aus der Gruppe Fluor, Chlor, Brom, Methoxy,  $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -Alkyl, Trifluormethyl und Trifluormethoxy substituiert sein kann,

und/oder deren Salzen.

30

2. Kosmetische Zubereitungen, gekennzeichnet durch einen Gehalt an 6-[4-(4-Chlor-phenoxy)-phenoxy-methyl]-1-hydroxy-4-methyl-2-pyridon.
3. Verwendung der kosmetischen Zubereitung nach Anspruch 1 oder 2 als Antischuppenmittel.
4. Verwendung der kosmetischen Zubereitung nach Anspruch 1 oder 2 als desodorierendes kosmetisches Mittel.

35

40

45

50

55



Europäisches  
Patentamt

# EUROPÄISCHER RECHERCHENBERICHT

Nummer der Anmeldung  
EP 94 11 5183

| EINSCHLÄGIGE DOKUMENTE  |   |  |   |
|---|---|--|---|
| Kategorie   | Kennzeichnung des Dokuments mit Angabe, soweit erforderlich, der maßgeblichen Teile   | Betrifft Anspruch  | KLASSIFIKATION DER ANMELDUNG (Int.Cl.6) |
| X   | MYCOSES,<br>Bd.34, Nr.SUP1, 1991<br>Seiten 91 - 93<br>H. HANEL 'Therapie des seborrhoischen Ekzems mit einem antiphlogistisch wirksamen Antimykotikum.'<br>* das ganze Dokument * | 1-3  | A61K7/06<br>A61K7/32                    |
| X,Y   | US-A-4 185 106 (W. DITTMAR)<br>* Spalte 1, Zeile 66 - Spalte 2, Zeile 1; Ansprüche *  | 1-3  |   |
| D   | & DE-C-22 34 009 (IBID.)<br>---   |  |   |
| X,Y   | DATABASE WPI<br>Derwent Publications Ltd., London, GB;<br>AN 84-033065 [06]<br>& JP-A-58 222 010 (LION CORP.)<br>* Zusammenfassung *  | 1,2,4  |   |
| Y   | EP-A-0 386 900 (THE PROCTER & GAMBLE COMPANY)<br>* das ganze Dokument *   | 4  | RECHERCHIERTE<br>SACHGEBIETE (Int.Cl.6) |
| D,Y   | EP-A-0 241 918 (HOECHST AG)<br>* das ganze Dokument *   | 1-4  | A61K                                    |
| Der vorliegende Recherchenbericht wurde für alle Patentansprüche erstellt   |   |  |   |
| Recherchenamt<br>DEN HAAG   |   | Abgeschlossen am der Recherche<br>12. Dezember 1994  | Prüfer<br>Orviz Diaz, P                 |
| KATEGORIE DER GENANNTEN DOKUMENTE   |   |  |   |
| X : von besonderer Bedeutung allein betrachtet<br>Y : von besonderer Bedeutung in Verbindung mit einer anderen Veröffentlichung derselben Kategorie<br>A : technologischer Hintergrund<br>O : nichtschützliche Offenbarung<br>P : Zwischenliteratur |   | T : der Erfindung zugrunde liegende Theorien oder Grundsätze<br>E : älteres Patentdokument, das jedoch erst am oder nach dem Anmeldedatum veröffentlicht worden ist<br>D : in der Anmeldung angeführtes Dokument<br>I : aus andern Gründen angeführtes Dokument<br>& : Mitglied der gleichen Patentfamilie, übereinstimmendes Dokument |   |

EP 94 11 5183 (P) (Int.Cl.6)